

PCT

REC'D 08 JUL 2004

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

(法第12条、法施行規則第56条)
[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号	T770/MCSPTA	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/12565	国際出願日 (日.月.年) 01. 10. 2003	優先日 (日.月.年) 01. 10. 2002	
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ¹ C07D277/12, B01J31/02, 38/00, C07C321/04, 321/08			
出願人 (氏名又は名称) 鐘淵化学工業株式会社			

1. この報告書は、PCT第35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。
法施行規則第57条（PCT第36条）の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a ☐ 附属書類は全部で _____ ページである。
- ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）
- ☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b ☐ 電子媒体は全部で _____ （電子媒体の種類、数を示す）。
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。（実施細則第802号参照）

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- | | | |
|-------------------------------------|-----|---|
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第Ⅰ欄 | 国際予備審査報告の基礎 |
| <input type="checkbox"/> | 第Ⅱ欄 | 優先権 |
| <input type="checkbox"/> | 第Ⅲ欄 | 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 |
| <input type="checkbox"/> | 第Ⅳ欄 | 発明の単一性の欠如 |
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第Ⅴ欄 | P C T 3 5 条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 |
| <input checked="" type="checkbox"/> | 第Ⅵ欄 | ある種の引用文献 |
| <input type="checkbox"/> | 第Ⅶ欄 | 国際出願の不備 |
| <input type="checkbox"/> | 第Ⅷ欄 | 国際出願に対する意見 |

国際予備審査の請求書を受理した日 25.02.2004	国際予備審査報告を作成した日 18.06.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/J P) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 新 留 素 子	4 P	2939
	電話番号 03-3581-1101 内線 3490		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2004年1月)

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、_____ 語による翻訳文を基礎とした。
それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査
☐ PCT規則12.4にいう国際公開
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 _____ ページ、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 _____ 項、出願時に提出されたもの
第 _____ 項*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ 項*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 _____ ページ/図、出願時に提出されたもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの
第 _____ ページ/図*、 _____ 付けで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 第 _____ ページ/図
☐ 配列表(具体的に記載すること) _____
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) _____

* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	1-13	有 無
	請求の範囲	14-17	
進歩性 (I.S)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-17	
産業上の利用可能性 (I.A)	請求の範囲	1-17	有 無
	請求の範囲		

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

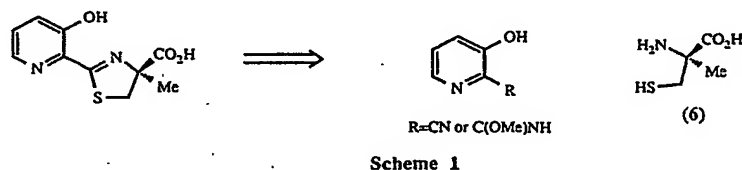
文献1: EP 45281 A1 (CIBA-GEIGY AG) 1982.02.03

本国際出願の請求の範囲第14項に記載の一般式(7)で、 R^1 : 炭素数1~12の脂肪族基、 R^2 : ピリド-2-イル、 R^7 : 炭素数1~7のアルキル基の化合物が記載されている。

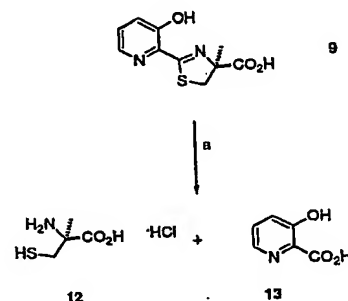
文献2: WO 00/12493 A1 (UNIVERSITY OF FLORIDA RESEARCH FOUNDATION INC.) 2000.03.09

本国際出願の請求の範囲第14項に記載の一般式(7)で、 R^1 : 14個以下の炭素原子を有するアルキル基、 R^2 : 置換基を有するフェニル基、 R^7 : 14個以下の炭素原子を有するアルキル基の化合物が記載されている。

文献3: MULQUEEN, G. C., 他, "Synthesis of the Thiazoline-based Siderophore (S)-Desferrithiocin", Tetrahedron Vol. 49 No. 24 pp5359-5364 (1993)
以下の反応工程が記載されている。



文献4: BERGERON, R. J., 他, "Effects of C-4' Stereochemistry and C-4' Hydroxylation on the Iron Clearing Efficiency and Toxicity of Desferrithiocin Analogues", J. Med. Chem 42 pp2432-2440 (1999)
右に示す反応工程が記載されている。



第VI欄 ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
EP 1302467 A2 (DSM Fine Chemicals Austria Nfg GmbH & Co KG) [EX]	16.04.2003	20.09.2002	16.10.2001

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

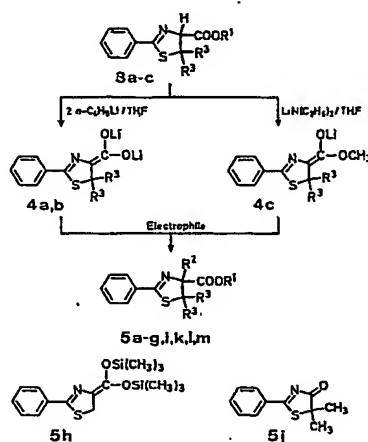
補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V. 2 欄の続き

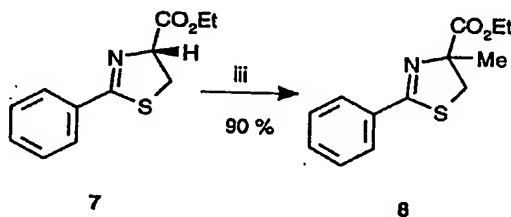
文献 5 : ADAM, W., 他, "Direct α -Lithiation of 4,5-Dihydro-1,3-thiazole-4-carboxylic Acids and Electrophilic Substitution",
SYNTHESIS (12) pp817-19 (1976)

本国際出願の請求の範囲第 14 項に記載の一般式 (7) で、 R^1 : 水素原子、 R^2 : フェニル基、 R^3 : メチル基、ベンジル基の化合物が ; また以下の反応工程が、記載されている。



文献 6 : EHRLER, J., 他, "Total Synthesis of Thiangazole",
SYNLETT (9) pp702-4 (1994)

以下の反応工程が記載されている。



補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

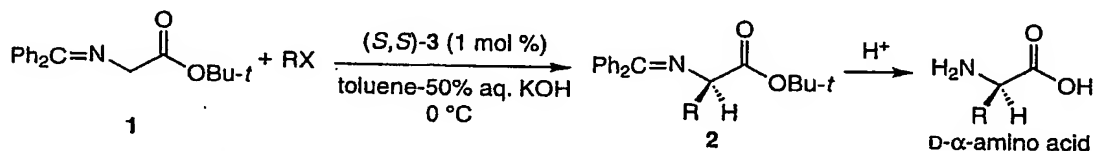
第 V. 2 欄の続き

文献 7 : OOI, T., 他, "Molecular Design of a C_2 -Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of α -Amino Acids"
J. Am. Chem. Soc. 121 pp6519-6520 (1999)

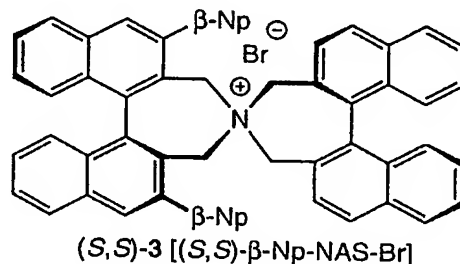
文献 8 : OKINO, T., 他, "Asymmetric Alkylation of tert-Butyl Glycinate Schiff Base with Chiral Quaternary Ammonium Salt under Micellar Conditions",
ORGANIC LETTERS Vol. 3. No. 10 pp1515-17 (2001)

文献 9 : OOI, T., 他, "Evaluation of the Efficiency of the Chiral Quaternary Ammonium Salt β -Np-NAS-Br in the Organic-Aqueous Phase-Transfer Alkylation of a Protected Glycine Derivative"
Adv. Synth. Catal 344 No. 3+4 pp288-291 (2002 May)

文献 7～9 には、以下の反応工程において、



次のような化合物を触媒とできることが記載されている。



*請求の範囲：14-17

請求の範囲第14項～第17項に記載の発明は、国際調査報告で引用された文献2により、新規性、進歩性を有しない。また、国際調査報告で引用された文献1, 5, 6により、進歩性を有しない。

文献2には、本国際出願の一般式(7)で示される化合物と重複する化合物が記載されている。文献1に記載のピリジル基をフェニル基とする化合物を得ること；文献5に示される化合物のカルボン酸をエステル基としたり、文献6の化合物8の環に結合するアルキル基の炭素数を変更したりすることは当業者が容易になし得ることである。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V. 2 欄の続き

*請求の範囲：1－10

請求の範囲第1項～第10項に記載の発明は、国際調査報告で引用された文献5～9により、進歩性を有しない。

本国際出願の一般式(2)で示される化合物から同(1)で示される化合物への反応は文献5, 6で知られているところ、同様な反応(文献7～9)で使用されている光学活性4級アンモニウム塩を触媒として使用することに格別の創意を認めることができない。

Translation

Rec'd PCT/PTO 24 MAR 2005

PCT/JP2003/012565

PATENT COOPERATION TREATY



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference T770/MCSPTA	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/012565	International filing date (day/month/year) 01 October 2003 (01.10.2003)	Priority date (day/month/year) 01 October 2002 (01.10.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 277/12, B01J 31/02, 38/00, C07C 321/04, 321/08		
Applicant KANEKA CORPORATION		

- This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
- This REPORT consists of a total of 8 sheets, including this cover sheet.
- This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
 - ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of _____ sheets, as follows:
 - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
 - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
 - ☐ (sent to the International Bureau only) a total of _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
- This report contains indications relating to the following items:

<input checked="" type="checkbox"/> Box No. I	Basis of the report
<input type="checkbox"/> Box No. II	Priority
<input type="checkbox"/> Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
<input type="checkbox"/> Box No. IV	Lack of unity of invention
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. VI	Certain documents cited
<input type="checkbox"/> Box No. VII	Certain defects in the international application
<input type="checkbox"/> Box No. VIII	Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 25 February 2004 (25.02.2004)	Date of completion of this report 18 June 2004 (18.06.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/012565

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
 - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
 - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ The international application as originally filed/furnished
- ☐ the description:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the claims:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ the drawings:
- pages _____, as originally filed/furnished
- pages* _____ received by this Authority on _____
- pages* _____ received by this Authority on _____
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/figs _____
- ☐ the sequence listing (*specify*): _____
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/JP 03/12565

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-13	YES
	Claims	14-17	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-17	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-17	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: EP 45281 A1 (Ciba-Geigy AG), 03 February 1982

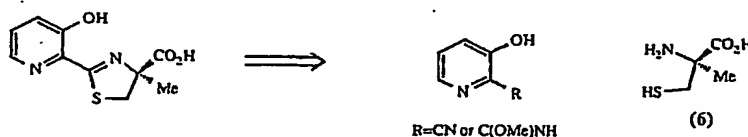
Document 1 discloses the compounds represented by general formula (7) as set forth in claim 14 of the present international application wherein R¹ is an aliphatic group with a carbon number between 1-12, R² is pyrido-2-yl and R⁷ is an alkyl group with a carbon number between 1-7.

Document 2: WO 00/12493 A1 (University of Florida Research Foundation, Inc.), 09 March 2000

Document 2 discloses the compounds represented by general formula (7) as set forth in claim 14 of the present international application wherein R¹ is an alkyl group that contains 14 or fewer carbon atoms, R² is a phenyl group that contains a substituent group and R⁷ is an alkyl group that contains 14 or fewer carbon atoms.

Document 3: G. C. MULQUEEN et al., "Synthesis of the Thiazoline-based Siderophore (S)-Desferrithiocin," Tetrahedron, Vol. 49, No. 24, pp. 5359-5364, 1993

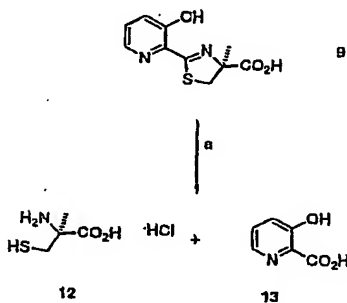
Document 3 discloses the following reaction step.



Scheme 1

Document 4: R. J. BERGERON et al., "Effects of C-4 Stereochemistry and C-4' Hydroxylation on the Iron Clearing Efficiency and Toxicity of Desferrithiocin Analogues," J. Med. Chem., Vol. 42, pp. 2432-2440, 1999

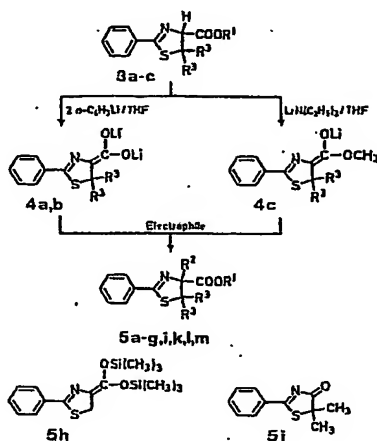
Document 4 discloses the following reaction step.



Document 5: W. ADAM et al., "Direct α -Lithiation of 4, 5-Dihydro-1, 3-thiazole-4-carboxylic Acids and Electrophilic Substitution," Synthesis, Vol. 12, pp. 817-819, 1976

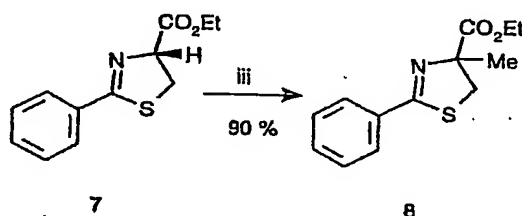
Document 5 discloses the compounds represented by general formula (7) as set forth in claim 14 of the present international application wherein R¹ is a hydrogen atom, R² is a phenyl group and R⁷ is a methyl group or a

benzyl group. In addition, document 5 discloses the following reaction steps.



Document 6: J. EHRLER et al., "Total Synthesis of Thiangazole," Synlett, Vol. 9, pp. 702-704, 1994

Document 6 discloses the following reaction step.



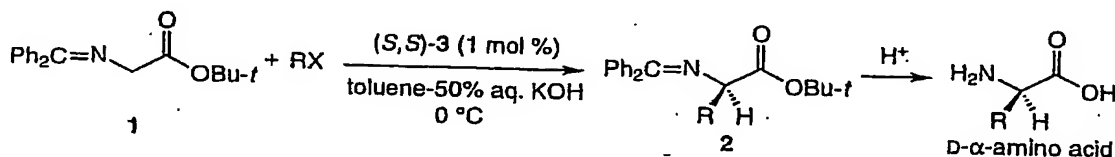
Document 7: T. OOI et al., "Molecular Design of a C_2 -Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of α -Amino Acids," J. AM. Chem. Soc., Vol. 121, pp. 6519-6520, 1999

Document 8: T. OKINO et al., "Asymmetric Alkylation of Tert-Butyl Glycinate Schiff Base with Chiral Quaternary Ammonium Salt under Micellar Conditions," Organic Letters, Vol. 3, No.

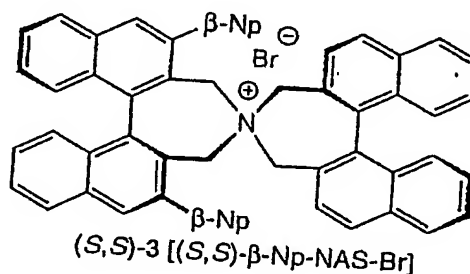
10, pp. 1515-1517, 2001

Document 9: T. OOI et al., "Evaluation of the Efficiency of the Chiral Quaternary Ammonium Salt β -Np-NAS-Br in the Organic-Aqueous Phase-Transfer Alkylation of a Protected Glycine Derivative," Adv. Synth. Catal., Vol. 344, No. 3+4, pp. 288-291, May 2000

Documents 7-9 disclose the following reaction steps.



Furthermore, documents 7-9 indicate that it is possible to use a compound that is represented by the following formula as the catalyst in the abovementioned reaction steps.



Claims 14-17

The inventions that are set forth in claims 14-17 lack novelty and do not involve an inventive step in the light of document 2 cited in the international search report. In addition, claims 14-17 do not involve an inventive step in the light of documents 1, 5 and 6 cited in the international search report.

Document 2 discloses a range of compounds that overlaps with the compounds that are represented by general formula (7) as set forth in the present

international application. Likewise, it would be easy for a person skilled in the art to substitute a phenyl group for the pyridyl group in the compounds that are disclosed in document 1, to substitute an ester group for the carboxylic acid in the compounds that are disclosed in document 5 or to modify the carbon number of the alkyl group that is bonded to the ring of compound 8 as disclosed in document 6.

Claims 1-10

The inventions that are set forth in claims 1-10 do not involve an inventive step in the light of documents 5-9 cited in the international search report.

The reaction for forming compounds that are represented by general formula (1) as set forth in the present international application from compounds that are represented by general formula (2) as set forth in the present international application is well known, as disclosed in documents 5 and 6, and it is not considered to require any special creativity to conceive of employing optically active quaternary ammonium salts, which are used in similar reactions (refer to documents 7-9), as the catalyst in this well-known reaction.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2003/012565

Box No. VI Certain documents cited

1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
EP 1302467 A2 (DSM Fine Chemicals Austria Nfg GmbH & Co KG) [EX]	16 April 2003 (16.04.2003)	20 September 2002 (20.09.2002)	16 October 2001 (16.10.2001)

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)